

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
9. September 2005 (09.09.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/082871 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 277/48**, 417/04, 277/82, 285/12, 285/08, 249/14, 237/22, 231/56, 263/28, 261/14, A61K 31/425

(74) Anwalt: DIETEL, Anja; Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, Maximilianstrasse 58, 80538 München (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/001521

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(22) Internationales Anmeldedatum: 15. Februar 2005 (15.02.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 008 141.7 19. Februar 2004 (19.02.2004) DE

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **ABBOTT GMBH & CO. KG** [DE/DE]; Max-Planck-Ring 2, 65205 Wiesbaden (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **NETZ, Astrid** [DE/DE]; Mönchwörthstrasse 62, 68199 Mannheim (DE). **AMBERG, Wilhelm** [DE/DE]; Rastatter Str. 55, 68239 Mannheim (DE). **LANGE, Udo** [DE/DE]; Wilhelm-Blos-Str. 10, 68199 Mannheim (DE). **OCHSE, Michael** [DE/DE]; Goethestr. 4, 67098 Bad Dürkheim (DE). **HUTCHINS, Charles, W.** [US/US]; 31005 Prairie Ridge Rd, Green Oaks, IL 60058 (US). **GARCIA-LADONA, Francisco-Xavier** [DE/DE]; Brehmstrasse 107i, 76870 Kandel (DE). **WERNET, Wolfgang** [DE/DE]; Freiheitstrasse 73, 67434 Neustadt/Weinstraße (DE). **KLING, Andreas** [DE/DE]; Riegeler Weg 14, 68239 Mannheim (DE).

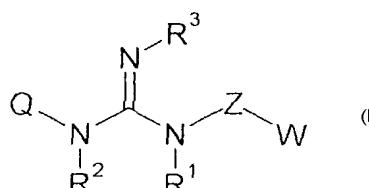
Veröffentlicht:
— mit internationalem Recherchenbericht
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 10. November 2005

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: GUANIDINE COMPOUNDS, AND USE THEREOF AS BINDING PARTNERS FOR 5-HT5 RECEPTORS

(54) Bezeichnung: GUANIDINVERBINDUNGEN UND IHRE VERWENDUNG ALS BINDUNGSPARTNER FÜR 5-HT5-REZEPTOREN



(57) Abstract: The invention relates to guanidine compounds of general formula (I), corresponding enantiomeric, diastereomeric, and/or tautomeric forms thereof, and pharmaceutically acceptable salts thereof. The invention further relates to the use of guanidine compounds as binding partners for 5-HT5 receptors in order to treat diseases modulated by 5-HT5 receptor activity, especially treat neurodegenerative and neuropsychiatric disorders and the signs, symptoms, and malfunctions associated therewith.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Guanidinverbindungen der allgemeinen Formel (I) entsprechende enantiomere, diastereomere und/oder tautomere Formen davon sowie pharmazeutisch annehmbare Salze davon. Weiterhin betrifft die vorliegende Verbincaung die Verwendung von Guanidinverbindungen als Bindungspartner für 5-HT5-Rezeptoren zur Behandlung von Krankheiten, die durch eine 5-HT5-Rezeptoraktivität moduliert werden, insbesondere zur Behandlung von neurodegenerativen und neuropsychiatrischen Störungen sowie den damit zusammenhängenden Anzeichen, Symptomen und Fehlfunktionen.

WO 2005/082871 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/001521

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D277/48 C07D417/04 C07D277/82 C07D285/12 C07D285/08
 C07D249/14 C07D237/22 C07D231/56 C07D263/28 C07D261/14
 A61K31/425

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori Agents. 5. 2-(Substituted guanidino)-4-arylthiazoles and Aryloxazole Analogues" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, vol. 45, no. 1, 2002, pages 143-150, XP002339344 ISSN: 0022-2623 examples 39-41,44,46-49</p> <p>-----</p> <p style="text-align: center;">-/--</p>	1,12,13

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
24 August 2005	22/09/2005
Name and mailing address of the ISA	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Von Daacke, A

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/001521

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori Agents. 4. 2-(Substituted guanidino)-4-phenylthiazoles and Some Structurally Rigid Derivatives" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, vol. 43, no. 17, 2000, pages 3315-3321, XP002339345 ISSN: 0022-2623 examples 36-42 ----- HOGBERG, MARITA ET AL: "Bioisosteric modification of PTT-HIV-1 RT-inhibitors: synthesis and biological evaluation" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS , CODEN: BMCLE8, vol. 10, no. 3, 2000, pages 265-268, XP002339346 ISSN: 0960-894X tables 1,2 ----- KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori agents. 3. 2-'(Arylalkyl)guanidino!-4- furylthiazoles" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, vol. 42, no. 15, 1999, pages 2920-2926, XP002339347 ISSN: 0022-2623 table 1 ----- GUPTA, S. ET AL: "Superpendentic Index: A novel topological descriptor for predicting biological activity" JOURNAL OF CHEMICAL INFORMATION AND COMPUTER SCIENCES , CODEN: JCISD8, vol. 39, no. 2, 1999, pages 272-277, XP002339348 ISSN: 0095-2338 examples 8,27 ----- DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KATSURA, YOSUKE ET AL: "Preparation of furylthiazoles as ulcer inhibitors" XP002341494 retrieved from STN Database accession no. 1997:195723 RN 187592-36-5;187592-37-6;187592_38-7;187592 -39-8;187592-38-7;187592-40-1;187592-41-2. abstract	1,12,13 1,12,13 1,12,13 1,12,13 1,12,13 1,12,13 1,12,13 1,12,13 1,12,13 1,12,13 ----- -/-

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/001521

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>& JP 09 040671 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO, JAPAN) 10 February 1997 (1997-02-10)</p> <p>-----</p> <p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KATSURA, YOSUKE ET AL: "Preparation of guanidinothiazole derivatives as histamine H₂ antagonists" XP002341495 retrieved from STN Database accession no. 1997:140933 RN186686-50-0;186686-62-4;186686-61-3;1866 86-70-4;186686-69-1;186686-76-0;186686-87- 3;1876686-75-9;186686-86-2;186686-90-8;186 686-96-4;186686-99-7;186687-00-3;186686-01 -4. abstract & JP 08 337579 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO, JAPAN) 24 December 1996 (1996-12-24)</p> <p>-----</p>	1,12,13
X	<p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KAWANISHI, YASUYUKI ET AL: "Synthesis and biological evaluation of a new reversely linked type of dual histamine H₂ and gastrin receptor antagonist" XP002341496 retrieved from STN Database accession no. 1997:81087 RN 187816-96-2;187816-97-3. abstract & CHEMICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN CODEN: CPBTAL, vol. 45, no. 1, 1997, pages 116-124, ISSN: 0009-2363</p> <p>-----</p>	1,12,13
X	<p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; "Preparation of 4-thienylthiazole derivatives as antiulcer and antibacterial agents" XP002341497 retrieved from STN Database accession no. 1997:42 RN184581-58-6 und alle weiteren Verbindungen bis einschliesslich 184582-15-8. abstract & JP 08 245621 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 24 September 1996 (1996-09-24)</p> <p>-----</p> <p>-/-</p>	1,12,13

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/001521

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 96/05187 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 22 February 1996 (1996-02-22) Ansprüche; Beispiele 3,10 und 11. -----	1,12,13
X	WO 95/18126 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 6 July 1995 (1995-07-06) Ansprüche; Beispiele 1 (15-24), etc. -----	1,12,13
X	GOEL, ANSHU ET AL: "Structure-Activity Study on Antiulcer Agents Using Wiener's Topological Index and Molecular Connectivity Index" JOURNAL OF CHEMICAL INFORMATION AND COMPUTER SCIENCES, CODEN: JCISD8, vol. 35, no. 3, 1995, pages 504-509, XP002339349 ISSN: 0095-2338 examples 8,27 -----	1,12,13
X	EP 0 545 376 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 9 June 1993 (1993-06-09) claims 1-13; example 6(3) -----	1,12,13
X	WO 92/16526 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 1 October 1992 (1992-10-01) claims 1-10; example 49 -----	1,12,13
X	EP 0 259 085 A1 (PFIZER INC., USA) 9 March 1988 (1988-03-09) claims 1-6; example 15(2) -----	1,12,13
X	US 4 560 690 A (REITER, LAWRENCE ALAN) 24 December 1985 (1985-12-24) claims 1-27; examples 6p-6u -----	1,12,13
X	JP 59 036674 A (YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 28 February 1984 (1984-02-28) Verbindungen 9,10, abstract -----	1,12,13
X	WO 02/16318 A (PACIFIC CORPORATION; SUH, YOUNG, GER; OH, UH, TAEK; KIM, HEE, DOO; LEE) 28 February 2002 (2002-02-28) the whole document -----	1-22
X	WO 99/20599 A (CAMBRIDGE NEUROSCIENCE, INC) 29 April 1999 (1999-04-29) the whole document -----	1-22
	-/-	

INTERNATIONAL SEARCH REPORTInternational Application No
PCT/EP2005/001521**C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 02/36544 A (TOKUYAMA CORPORATION; WATANABE, SHIN; KAWAHARA, MIZUE) 10 May 2002 (2002-05-10) the whole document -----	1-22
X	GB 1 031 165 A (THE WELLCOME FOUNDATION LIMITED) 25 May 1966 (1966-05-25) the whole document -----	1-22

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/001521

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
JP 9040671	A	10-02-1997	NONE			
JP 8337579	A	24-12-1996	NONE			
JP 8245621	A	24-09-1996	NONE			
WO 9605187	A1	22-02-1996	AU JP	3192995 A 2000504305 T	07-03-1996 11-04-2000	
WO 9518126	A1	06-07-1995	AU JP	1283195 A 9507222 T	17-07-1995 22-07-1997	
EP 0545376	A1	09-06-1993	AT AU AU CA CN DE DE HU HU JP JP MX US ZA	170851 T 666893 B2 2983792 A 2084640 A1 1079469 A 69226931 D1 69226931 T2 65776 A2 9500396 A3 2531329 B2 6321921 A 9206930 A1 5532258 A 9208876 A	15-09-1998 29-02-1996 10-06-1993 07-06-1993 15-12-1993 15-10-1998 18-03-1999 28-07-1994 28-09-1995 04-09-1996 22-11-1994 01-06-1993 02-07-1996 15-07-1993	
WO 9216526	A1	01-10-1992	CA EP JP US	2105981 A1 0575614 A1 6505724 T 5364871 A	14-09-1992 29-12-1993 30-06-1994 15-11-1994	
EP 0259085	A1	09-03-1988	AT DE DK ES GR IE JP JP JP PT US	66477 T 3772301 D1 451687 A 2031514 T3 3002596 T3 60039 B1 1910156 C 6033258 B 63063678 A 85604 A , B 5026715 A	15-09-1991 26-09-1991 13-05-1988 16-12-1992 25-01-1993 18-05-1994 09-03-1995 02-05-1994 22-03-1988 01-09-1987 25-06-1991	
US 4560690	A	24-12-1985	AR AT AU AU CA CN CS CS DD DE DK EG EP ES	241784 A1 44741 T 554271 B2 4179085 A 1262352 A1 85103265 A , B 248741 B2 248750 B2 233374 A5 3571618 D1 190885 A , B, 17391 A 0161841 A1 8605511 A1	30-12-1992 15-08-1989 14-08-1986 07-11-1985 17-10-1989 10-12-1986 12-02-1987 12-02-1987 26-02-1986 24-08-1989 31-10-1985 30-12-1992 21-11-1985 01-09-1986	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/001521

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date	
US 4560690	A	ES FI GR HU IL IN JP JP JP KR KR MX NO NZ PH PL PL PT SU SU YU YU ZA	8606336 A1 851683 A ,B, 851020 A1 37787 A2 75038 A 165501 A1 1470507 C 60239474 A 63016387 B 8700925 B1 8700924 B1 9203542 A1 851695 A ,B, 211909 A 21824 A 253107 A1 257845 A1 80361 A ,B 1380614 A3 1400508 A3 72385 A1 114587 A1 8503161 A	01-10-1986 31-10-1985 25-11-1985 28-02-1986 31-07-1988 04-11-1989 14-12-1988 28-11-1985 08-04-1988 07-05-1987 07-05-1987 01-09-1992 31-10-1985 30-03-1988 04-03-1988 03-06-1986 07-10-1986 01-05-1985 07-03-1988 30-05-1988 29-02-1988 29-02-1988 30-12-1986	
JP 59036674	A	28-02-1984	NONE		
WO 0216318	A	28-02-2002	AU AU CA CN EP EP JP JP WO WO KR KR NZ US US	8022901 A 8023001 A 2417507 A1 1418191 A 1303483 A1 1311478 A1 2004506713 T 2004506714 T 0216318 A1 0216319 A1 2002039226 A 2002030009 A 523882 A 2003153596 A1 2003212140 A1	04-03-2002 04-03-2002 28-02-2002 14-05-2003 23-04-2003 21-05-2003 04-03-2004 04-03-2004 28-02-2002 28-02-2002 25-05-2002 22-04-2002 26-11-2004 14-08-2003 13-11-2003
WO 9920599	A	29-04-1999	AU CA EP JP WO	1362699 A 2307597 A1 1032556 A1 2001520215 T 9920599 A1	10-05-1999 29-04-1999 06-09-2000 30-10-2001 29-04-1999
WO 0236544	A	10-05-2002	JP CN EP WO US	2002145837 A 1473145 A 1338588 A1 0236544 A1 2004102646 A1	22-05-2002 04-02-2004 27-08-2003 10-05-2002 27-05-2004
GB 1031165	A	25-05-1966	DE	1518231 A1	30-04-1970

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/001521

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7	C07D277/48	C07D417/04	C07D277/82	C07D285/12	C07D285/08
	C07D249/14	C07D237/22	C07D231/56	C07D263/28	C07D261/14
	A61K31/425				

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie ^a	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori Agents. 5. 2-(Substituted guanidino)-4-arylthiazoles and Aryloxazole Analogues" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, Bd. 45, Nr. 1, 2002, Seiten 143-150, XP002339344 ISSN: 0022-2623 Beispiele 39-41,44,46-49</p> <p>-----</p> <p style="text-align: center;">-/--</p>	1,12,13

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

^a Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung,

eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

24. August 2005

22/09/2005

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL – 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Von Daacke, A

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/001521

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori Agents. 4. 2-(Substituted guanidino)-4-phenylthiazoles and Some Structurally Rigid Derivatives" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, Bd. 43, Nr. 17, 2000, Seiten 3315-3321, XP002339345 ISSN: 0022-2623 Beispiele 36-42 -----	1,12,13
X	HOGBERG, MARITA ET AL: "Bioisosteric modification of PETT-HIV-1 RT-inhibitors: synthesis and biological evaluation" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS , CODEN: BMCLE8, Bd. 10, Nr. 3, 2000, Seiten 265-268, XP002339346 ISSN: 0960-894X Tabellen 1,2 -----	1,12,13
X	KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori agents. 3. 2-'(Arylalkyl)guanidino!-4- furylthiazoles" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, Bd. 42, Nr. 15, 1999, Seiten 2920-2926, XP002339347 ISSN: 0022-2623 Tabelle 1 -----	1,12,13
X	GUPTA, S. ET AL: "Superpendentic Index: A novel topological descriptor for predicting biological activity" JOURNAL OF CHEMICAL INFORMATION AND COMPUTER SCIENCES , CODEN: JCISD8, Bd. 39, Nr. 2, 1999, Seiten 272-277, XP002339348 ISSN: 0095-2338 Beispiele 8,27 -----	1,12,13
X	DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KATSURA, YOSUKE ET AL: "Preparation of furylthiazoles as ulcer inhibitors" XP002341494 gefunden im STN Database accession no. 1997:195723 RN 187592-36-5;187592-37-6;187592_38-7;187592 -39-8;187592-38-7;187592-40-1;187592-41-2. Zusammenfassung -/-	1,12,13

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/001521

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>& JP 09 040671 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO, JAPAN) 10. Februar 1997 (1997-02-10)</p> <p>-----</p> <p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KATSURA, YOSUKE ET AL: "Preparation of guanidinothiazole derivatives as histamine H₂ antagonists" XP002341495 gefunden im STN Database accession no. 1997:140933 RN186686-50-0;186686-62-4;186686-61-3;186686-70-4;186686-69-1;186686-76-0;186686-87-3;1876686-75-9;186686-86-2;186686-90-8;186686-96-4;186686-99-7;186687-00-3;186686-01-4. Zusammenfassung & JP 08 337579 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO, JAPAN) 24. Dezember 1996 (1996-12-24)</p> <p>-----</p>	1,12,13
X	<p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KAWANISHI, YASUYUKI ET AL: "Synthesis and biological evaluation of a new reversely linked type of dual histamine H₂ and gastrin receptor antagonist" XP002341496 gefunden im STN Database accession no. 1997:81087 RN 187816-96-2;187816-97-3. Zusammenfassung & CHEMICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN CODEN: CPBTAL, Bd. 45, Nr. 1, 1997, Seiten 116-124, ISSN: 0009-2363</p> <p>-----</p>	1,12,13
X	<p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; "Preparation of 4-thienylthiazole derivatives as antiulcer and antibacterial agents" XP002341497 gefunden im STN Database accession no. 1997:42 RN184581-58-6 und alle weiteren Verbindungen bis einschliesslich 184582-15-8. Zusammenfassung & JP 08 245621 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 24. September 1996 (1996-09-24)</p> <p>-----</p>	1,12,13
		-/-

INTERNATIONAHLER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/001521

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 96/05187 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 22. Februar 1996 (1996-02-22) Ansprüche; Beispiele 3,10 und 11. -----	1,12,13
X	WO 95/18126 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 6. Juli 1995 (1995-07-06) Ansprüche; Beispiele 1 (15-24), etc. -----	1,12,13
X	GOEL, ANSHU ET AL: "Structure-Activity Study on Antiulcer Agents Using Wiener's Topological Index and Molecular Connectivity Index" JOURNAL OF CHEMICAL INFORMATION AND COMPUTER SCIENCES, CODEN: JCISD8, Bd. 35, Nr. 3, 1995, Seiten 504-509, XP002339349 ISSN: 0095-2338 Beispiele 8,27 -----	1,12,13
X	EP 0 545 376 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 9. Juni 1993 (1993-06-09) Ansprüche 1-13; Beispiel 6(3) -----	1,12,13
X	WO 92/16526 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 1. Oktober 1992 (1992-10-01) Ansprüche 1-10; Beispiel 49 -----	1,12,13
X	EP 0 259 085 A1 (PFIZER INC., USA) 9. März 1988 (1988-03-09) Ansprüche 1-6; Beispiel 15(2) -----	1,12,13
X	US 4 560 690 A (REITER, LAWRENCE ALAN) 24. Dezember 1985 (1985-12-24) Ansprüche 1-27; Beispiele 6p-6u -----	1,12,13
X	JP 59 036674 A (YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 28. Februar 1984 (1984-02-28) Verbindungen 9,10, Zusammenfassung -----	1,12,13
X	WO 02/16318 A (PACIFIC CORPORATION; SUH, YOUNG, GER; OH, UH, TAEK; KIM, HEE, DOO; LEE) 28. Februar 2002 (2002-02-28) das ganze Dokument -----	1-22
X	WO 99/20599 A (CAMBRIDGE NEUROSCIENCE, INC) 29. April 1999 (1999-04-29) das ganze Dokument -----	1-22
	-/-	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHTInternationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/001521**C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 02/36544 A (TOKUYAMA CORPORATION; WATANABE, SHIN; KAWAHARA, MIZUE) 10. Mai 2002 (2002-05-10) das ganze Dokument -----	1-22
X	GB 1 031 165 A (THE WELLCOME FOUNDATION LIMITED) 25. Mai 1966 (1966-05-25) das ganze Dokument -----	1-22

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/001521

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
JP 9040671	A	10-02-1997	KEINE			
JP 8337579	A	24-12-1996	KEINE			
JP 8245621	A	24-09-1996	KEINE			
WO 9605187	A1	22-02-1996	AU JP	3192995 A 2000504305 T	07-03-1996 11-04-2000	
WO 9518126	A1	06-07-1995	AU JP	1283195 A 9507222 T	17-07-1995 22-07-1997	
EP 0545376	A1	09-06-1993	AT AU AU CA CN DE DE HU HU JP JP MX US ZA	170851 T 666893 B2 2983792 A 2084640 A1 1079469 A 69226931 D1 69226931 T2 65776 A2 9500396 A3 2531329 B2 6321921 A 9206930 A1 5532258 A 9208876 A	15-09-1998 29-02-1996 10-06-1993 07-06-1993 15-12-1993 15-10-1998 18-03-1999 28-07-1994 28-09-1995 04-09-1996 22-11-1994 01-06-1993 02-07-1996 15-07-1993	
WO 9216526	A1	01-10-1992	CA EP JP US	2105981 A1 0575614 A1 6505724 T 5364871 A	14-09-1992 29-12-1993 30-06-1994 15-11-1994	
EP 0259085	A1	09-03-1988	AT DE DK ES GR IE JP JP JP PT US	66477 T 3772301 D1 451687 A 2031514 T3 3002596 T3 60039 B1 1910156 C 6033258 B 63063678 A 85604 A , B 5026715 A	15-09-1991 26-09-1991 13-05-1988 16-12-1992 25-01-1993 18-05-1994 09-03-1995 02-05-1994 22-03-1988 01-09-1987 25-06-1991	
US 4560690	A	24-12-1985	AR AT AU AU CA CN CS CS DD DE DK EG EP ES	241784 A1 44741 T 554271 B2 4179085 A 1262352 A1 85103265 A , B 248741 B2 248750 B2 233374 A5 3571618 D1 190885 A , B, 17391 A 0161841 A1 8605511 A1	30-12-1992 15-08-1989 14-08-1986 07-11-1985 17-10-1989 10-12-1986 12-02-1987 12-02-1987 26-02-1986 24-08-1989 31-10-1985 30-12-1992 21-11-1985 01-09-1986	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/001521

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
US 4560690	A		ES 8606336 A1 FI 851683 A ,B, GR 851020 A1 HU 37787 A2 IL 75038 A IN 165501 A1 JP 1470507 C JP 60239474 A JP 63016387 B KR 8700925 B1 KR 8700924 B1 MX 9203542 A1 NO 851695 A ,B, NZ 211909 A PH 21824 A PL 253107 A1 PL 257845 A1 PT 80361 A ,B SU 1380614 A3 SU 1400508 A3 YU 72385 A1 YU 114587 A1 ZA 8503161 A		01-10-1986 31-10-1985 25-11-1985 28-02-1986 31-07-1988 04-11-1989 14-12-1988 28-11-1985 08-04-1988 07-05-1987 07-05-1987 01-09-1992 31-10-1985 30-03-1988 04-03-1988 03-06-1986 07-10-1986 01-05-1985 07-03-1988 30-05-1988 29-02-1988 29-02-1988 30-12-1986
JP 59036674	A	28-02-1984	KEINE		
WO 0216318	A	28-02-2002	AU 8022901 A AU 8023001 A CA 2417507 A1 CN 1418191 A EP 1303483 A1 EP 1311478 A1 JP 2004506713 T JP 2004506714 T WO 0216318 A1 WO 0216319 A1 KR 2002039226 A KR 2002030009 A NZ 523882 A US 2003153596 A1 US 2003212140 A1		04-03-2002 04-03-2002 28-02-2002 14-05-2003 23-04-2003 21-05-2003 04-03-2004 04-03-2004 28-02-2002 28-02-2002 25-05-2002 22-04-2002 26-11-2004 14-08-2003 13-11-2003
WO 9920599	A	29-04-1999	AU 1362699 A CA 2307597 A1 EP 1032556 A1 JP 2001520215 T WO 9920599 A1		10-05-1999 29-04-1999 06-09-2000 30-10-2001 29-04-1999
WO 0236544	A	10-05-2002	JP 2002145837 A CN 1473145 A EP 1338588 A1 WO 0236544 A1 US 2004102646 A1		22-05-2002 04-02-2004 27-08-2003 10-05-2002 27-05-2004
GB 1031165	A	25-05-1966	DE 1518231 A1		30-04-1970